

**(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG**

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
16. Januar 2003 (16.01.2003)

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 03/004465 A2

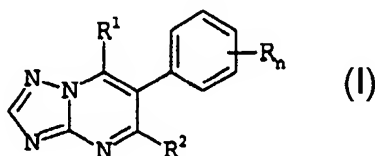
PCT

- | | | |
|---|-----------------------|--|
| (51) Internationale Patentklassifikation:
A01N /, C07C / | C07D , | (72) Erfinder; und |
| (21) Internationales Aktenzeichen: | PCT/EP02/07340 | (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): MÜLLER, Bernd
[DE/DE]; Jean-Ganss-Strasse 21, 67227 Frankenthal
(DE). SAUTER, Hubert [DE/DE]; Neckarpromenade 20,
68167 Mannheim (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE];
Goethestrasse 21, 56288 Kastellaun (DE). GRAM-
MENOS, Wassilios [GR/DE]; Samuel-Hahnemann-Weg
9, 67071 Ludwigshafen (DE). TORMO I BLASCO,
Jordi [ES/DE]; Mühlweg 47, 67117 Limburgerhof
(DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Hoehnhausen 18,
67157 Wachenheim (DE). GYPSEr, Andreas [DE/DE];
B 4,4, 68159 Mannheim (DE). RHEINHEIMER,
Joachim [DE/DE]; Merziger Strasse 24, 67063 Lud-
wigshafen (DE). ROSE, Ingo [DE/DE]; C 2, 19, 68159
Mannheim (DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römer-
strasse 1, 67308 Ottersheim (DE). SCHIEWECK, Frank
[DE/DE]; Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). RACK, |
| (22) Internationales Anmeldedatum:
3. Juli 2002 (03.07.2002) | | |
| (25) Einreichungssprache: | Deutsch | |
| (26) Veröffentlichungssprache: | Deutsch | |
| (30) Angaben zur Priorität:
101 32 059.0 5. Juli 2001 (05.07.2001) DE | | |
| (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BASF AKTIENGESSELLSCHAFT [DE/DE];
67056 Ludwigshafen (DE). | | |

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: FUNGICIDAL TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF AND USE THEREOF IN CONTROLLING NOXIOUS FUNGI AND AGENTS CONTAINING SAID COMPOUNDS

(54) Bezeichnung: FUNGIZIDE TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL



(57) Abstract: Triazolopyrimidines of formula (I), wherein the index and substituents have the following meaning: $n = 0$ or a whole number of 1 - 5; R = halogen, cyano, hydroxy, cyanate, alkyl, alkenyl, alkynyl, halogenalkyl, halogenalkenyl, alkoxy, alkenyloxy, alkynyloxy,

halogenalkoxy, cycloalkyl, cycloalkenyl, cycloalkoxy, alkoxycarbonyl, alkenyloxycarbonyl, alkinylloxycarbonyl, aminocarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkoximinoalkyl, alkenyloximinocarbonyl, alkinylloximinoalkyl, alkylcarbonyl, alkenylcarbonyl, alkinylcarbonyl, cycloalkylcarbonyl or a five to ten membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, containing one to four heteroatoms from the group O, N or S; R¹ = alkyl, alkenyl, alkinyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, phenyl, naphthyl or a five to ten membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, containing one to four heteroatoms from the group O, N or S, R and/or R¹ being able to be substituted according to the description; R² = alkyl, alkenyl or alkinyl which can be substituted by halogen, cyano, nitro, alkoxy or alkoxycarbonyl. The invention also relates to a method for the production of said compounds, agents containing same, and the use thereof in controlling noxious fungi.

(S7) Zusammenfassung: Triazolopyrimidine der Formel (I), in der der Index und die Substituenten folgende Bedeutung haben: n 0 oder eine ganze Zahl von 1 bis 5; R Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanat, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkoxy, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Cycloalkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyloxycarbonyl, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkoximinoalkyl, Alkenyloximinocarbonyl, Alkinyloximinocarbonyl, Alkylcarbonyl, Alkenylcarbonyl, Alkinylcarbonyl, Cycloalkylcarbonyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S; R¹ Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei R und/oder R¹ gemäss der Beschreibung substituiert sein können; R² Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl, die durch Halogen, Cyano, Nitro, Alkoxy oder Alkoxy-carbonyl substituiert sein können; Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen.



Michael [DE/DE]; Sandwingert 67, 69123 Heidelberg (DE). LORENZ, Gisela [DE/DE]; Erlenweg 13, 67434 Hambach (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]; Donnersbergstrasse 9, 67117 Limburgerhof (DE). AM-MERMANN, Eberhard [DE/DE]; Von-Gagern-Strasse 2, 64646 Heppenheim (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Ginsterstrasse 17, 67112 Mutterstadt (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESSELLSCHAFT; 67056 Ludwigshafen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,

SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

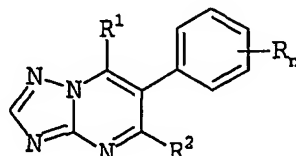
Fungizide Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

5

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft Triazolopyrimidine der Formel I,

10



I

in der der Index und die Substituenten folgende Bedeutung haben:

n 0 oder eine ganze Zahl von 1 bis 5;

R Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanato (OCN), C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₁₀-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkinyloxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkoxy, C₁-C₈-Alkoxycarbonyl, C₂-C₁₀-Alkenyloxycarbonyl, C₂-C₁₀-Alkinyloxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₈-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₈-)alkylaminocarbonyl, C₁-C₈-Alkoximinoalkyl, C₂-C₁₀-Alkenyloximinocarbonyl, C₂-C₁₀-Alkinyloximinocarbonyl, C₁-C₈-Alkylcarbonyl, C₂-C₁₀-Alkenylcarbonyl, C₂-C₁₀-Alkynylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S;

R¹ C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei R und/oder R¹ partiell oder vollständig halogeniert oder durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a substituiert sein können:

R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₃-C₆-Cycloal-

2

5 kyl, C₁-C₈-Alkoximino, C₂-C₁₀-Alkenyloximino, C₂-C₁₀-Alkinyloximino, Aryl-C₁-C₈-alkyloximino, C₂-C₁₀-Alkinyl, C₂-C₁₀-Alkenyloxycarbonyl, C₂-C₁₀-Alkinyloxycarbonyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, 10 enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

15 R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Di- 20 alkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

25 und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, 30 Aryl-C₁-C₆-alkoxy, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch 35 Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können; und

R² C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl oder C₂-C₄-Alkinyl, die durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₂-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl substituiert sein können. 40

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen.

3

Aus EP-A 71 792, EP-A 550 113, WO-A 94/20501, EP-A 834 513, WO-A 98/46608 und WO-A 99/41255 sind 5-Chlortriazolopyrimidine zur Bekämpfung von Schadpilzen bekannt.

- 5 Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirksamkeit zu finden.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden.

- 10 Desweiteren wurden Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

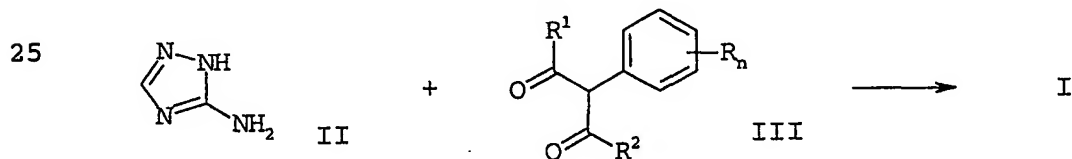
Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den

- 15 oben genannten Schriften in der Kombination des 5-Alkylrestes mit über Kohlenstoff gebundenen Gruppen in der 7-Position.

Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schadpilze auf.

20

Die Verbindungen I können auf verschiedenen Wegen erhalten werden; vorteilhaft geht man von 5-Aminotriazol der Formel II aus, das mit Dicarbonylverbindungen der Formel III kondensiert wird.



Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 80°C
30 bis 250°C, vorzugsweise 120°C bis 180°C, ohne Solvens oder in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 770 615] oder in Gegenwart von Essigsäure unter den aus Adv. Het. Chem. Bd. 57, S. 81ff. (1993) bekannten Bedingungen.

35

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether, Nitrile, Ketone, Alkohole, sowie N-Methylpyrrolidon, Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung
40 ohne Lösungsmittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

- 45 Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride, Alkali-

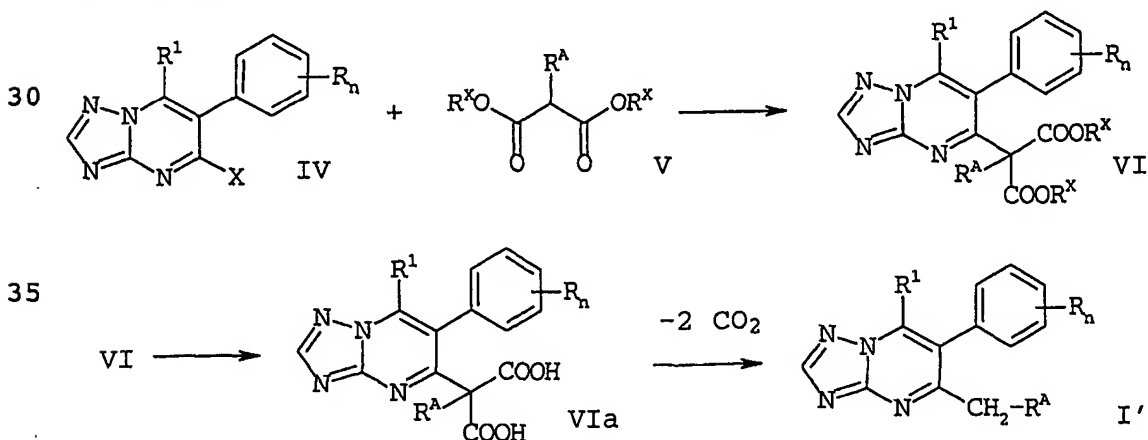
metallamide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate sowie Alkalimetallhydrogencarbonate, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle, Alkylmagnesiumhalogenide sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden tertiäre amine wie

10 Tri-isopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die Base und das Diketon III in einem Überschuß bezogen auf II einzusetzen.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I' sind auch zugänglich durch Umsetzung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel IV mit substituierten Malonsäureestern der Formel V, in der R^X für C₁-C₄-Alkyl, Allyl, Phenyl oder Benzyl steht, anschließend Verseifung des entstandenen Esters VI und Decarboxylierung der Carbonsäure VIa.



40 In Formel IV steht X für Halogen, insbesondere für Chlor oder Brom. Die Verbindungen IV sind aus den eingangs zitierten Schriften bekannt. In Formel I' haben n, R und R¹ die für Formel I definierte Bedeutung und R^A steht für Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl, das durch Halogen, Cyano, Nitro oder C₁-C₂-Alkoxy substituiert

45 sein kann.

5

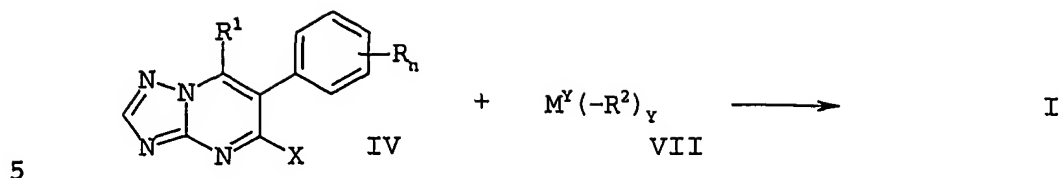
In einer bevorzugten Ausführungsform des erfindungsgemäßen Verfahrens bedeutet R^A Wasserstoff oder Methyl, insbesondere Wasserstoff.

- 5 Die Ausgangsstoffe V sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.
- 10 Die anschließende Spaltung des Esters erfolgt unter den allgemein üblichen Bedingungen [vgl.: Greene & Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, Wiley (1991), S. 224 ff: Spaltung von Alkylestern unter Pd-Katalyse (S. 248); hydrierende Spaltung von Benzylestern (S. 251); Spaltung von Methyl- bzw. Ethylestern in Gegenwart von Lithiumsalzen, wie LiI (S.232), LiBr oder LiCl; oder
- 15 unter sauren oder alkalischen Bedingungen]. In Abhängigkeit der Strukturelemente R^A, R_n und R¹ kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen VI vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I' bereits ganz oder teilweise erfolgen.
- 20

Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

- 25 Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe
- 30 wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und
- 35 tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.
- 40

- Verbindungen der Formel I können auch durch Kupplung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel IV mit metallorganischen Reagenzien der Formel VII erhalten werden. In einer Ausführungsform
- 45 dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.



In Formel VII steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; 10 Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, 15 z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gerei- 20 nigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend be- 25 schriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich 30 die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu be- 35 kämpfenden Schadpilz oder tierischen Schädling erfolgen.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

40

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B.

45 C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl,

1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethyl-
 5 butyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen
 10 Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl,
 15 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;

20 Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl,
 25 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl,
 30 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl,
 35 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl,
 40 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl,
 45 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

Alkinyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C₂-C₆-Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6, 8, 10 oder 12 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C₃-C₈-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl, oder C₇-C₁₂-Bicycloalkyl;

Aryl: ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem enthaltend 6 bis 14 Kohlenstoffringglieder, z.B. Phenyl, Naphthyl und Anthracenyl;

fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:

- 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl,

- 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl,
 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydro-
 fur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihy-
 drothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl,
 5 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyr-
 rolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isloxazolin-3-yl, 3-Isloxazo-
 lin-3-yl, 4-Isloxazolin-3-yl, 2-Isloxazolin-4-yl, 3-Isloxazolin-
 4-yl, 4-Isloxazolin-4-yl, 2-Isloxazolin-5-yl, 3-Isloxazolin-5-yl,
 4-Isloxazolin-5-yl, 2-Isythiazolin-3-yl, 3-Isythiazolin-3-yl,
 10 4-Isythiazolin-3-yl, 2-Isythiazolin-4-yl, 3-Isythiazolin-4-yl,
 4-Isythiazolin-4-yl, 2-Isythiazolin-5-yl, 3-Isythiazolin-5-yl,
 4-Isythiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyra-
 zol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl,
 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydro-
 15 pyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl,
 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydro-
 pyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl,
 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxa-
 zol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl,
 20 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxa-
 zol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl,
 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl,
 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl,
 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropy-
 25 rimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl,
 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Hexahy-
 drotriazin-3-yl;
- 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoff-
 atome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder
 30 Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlen-
 stoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei
 Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ring-
 glieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl,
 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isloxazolyl, 4-Isloxazolyl,
 35 5-Isloxazolyl, 3-Isythiazolyl, 4-Isythiazolyl, 5-Isythiazolyl,
 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl,
 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl,
 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadia-
 zol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl,
 40 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl
 und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- benzokondensiertes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis
 drei Stickstoffatome oder ein Stickstoffatom und ein Sauer-
 stoff- oder Schwefelatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche ne-
 45 ben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis
 drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als
 Ringglieder enthalten können, und in welchen zwei benachbarte

10

Kohlenstoffringglieder oder ein Stickstoff- und ein benachbartes Kohlenstoffringglied durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können;

- 5 - 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;
- 10

Alkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 3 bis 5 CH₂-Gruppen, z.B. CH₂, CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂ und CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂;

- 15 Oxyalkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH₂-Gruppen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂CH₂, OCH₂CH₂CH₂ und OCH₂CH₂CH₂CH₂;

- Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH₂-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂O, OCH₂CH₂O und OCH₂CH₂CH₂O.
- 20

- In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Razemate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.
- 25

- Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:
- 30

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R¹ für C₃-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₅-C₆-Cycloalkenyl steht.

- 35 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ für C₁-C₆-Alkyl oder C₁-C₆-Halogenalkyl steht.

- Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ für C₂-C₁₀-Alkenyl oder C₂-C₁₀-Alkinyl steht.
- 40

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder aromatischen Heterocyclus steht.

11

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R¹ für C₃-C₆-Cycloalkyl steht, welches durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann.

5 Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen R^a für Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkoximino, C₂-C₆-Alkenyloximino oder C₂-C₆-Alkinyloximino steht.

10 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^b für Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl oder C₁-C₆-Alkoxy steht.

Besonders bevorzugt werden auch Verbindungen I, in denen R² C₁-C₄-
15 Alkyl bedeutet, das durch Halogen substituiert sein kann.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R² für Methyl steht.

20 Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R² für Halogenmethyl steht.

Insbesondere werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen ein Substituent R in 2-Position steht und n eine ganze Zahl von 1 bis
25 4, insbesondere 1 bis 3, bedeutet.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen n 2 oder 3 bedeutet und ein Substituent R in 2-Position steht.

30 Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoximino-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-Alkenyloximino-C₁-C₆-alkyl oder C₁-C₆-Alkinyloximino-C₁-C₆-alkyl steht.

35 Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R für Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl oder Methoxy steht.

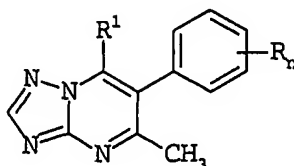
Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R_n für
2-Chlor, 2-Fluor, 2,6-Difluor, 2-Methoxy, 2-Trifluormethyl,
40 2-Trifluormethyl,6-chlor, 2-Chlor,6-fluor, 2,4,6-Trifluor, 2,6-Difluor,4-methoxy oder Pentafluor steht.

Insbesondere werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R_n für 2-Chlor,6-fluor, 2,6-Difluor,4-methoxy oder 2,4,6-Trifluor
45 steht.

12

Außerdem werden Verbindungen IA besonders bevorzugt, in denen n, R und R¹ die Bedeutungen wie in Formel I haben:

5



IA

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

15

Tabelle 1

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20 Tabelle 2

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 3

25 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,6-Difluor und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 4

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methoxy und R¹ für
30 eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 5

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Trifluormethyl und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-
35 spricht

Tabelle 6

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Trifluor-methyl, 6-chlor und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der
40 Tabelle A entspricht

Tabelle 7

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor, 6-fluor und R¹ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-
45 spricht

Tabelle 8

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,4,6-Trifluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5 Tabelle 9

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,6-Difluor,4-methoxy und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 Tabelle 10

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für Pentafluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 11

- 15 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,3-methyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 12

- 20 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 13

- Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,4-Dimethyl und R^1
25 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 14

- Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,5-Dimethyl und R^1
für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
30

Tabelle 15

- Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-ethyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
35

Tabelle 16

- Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-cyano und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
40

Tabelle 17

- Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-brom und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht
45

Tabelle 18

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-chlor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 19

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-fluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 20

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,5-fluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 21

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-methoxy und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 22

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-methoxycarbonyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 23

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-ethoxycarbonyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 24

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,5-Dimethyl,4-brom und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 25

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,4-Difluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40 Tabelle 26

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-brom und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 27

45 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-chlor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 28

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-methoxy und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 29

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-methyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 30

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,5-methyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 31

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-methoxycarbonyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 32

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-ethoxycarbonyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 33

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-ethyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 34

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-cyano und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 35

35 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,4,5-Trifluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 36

40 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,4-Dichlor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 37

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-fluoro und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

45 spricht

Tabelle 38

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-methoxy und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 39

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-methyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 40

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-brom und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15 Tabelle 41

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-ethyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 42

20 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-methoxycarbonyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 43

25 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-ethoxycarbonyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 44

30 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-cyano und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle A

35	Nr.	R^1
	A-1	CH_3
40	A-2	CH_2CH_3
	A-3	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
	A-4	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
	A-5	$\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
	A-6	$(\pm) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
	A-7	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
45	A-8	$(S) \text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$
	A-9	$(\text{CH}_2)_3\text{CH}_3$
	A-10	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$

Nr.	R^1
A-11	$(CH_2)_4CH_3$
A-12	$CH(CH_2CH_3)_2$
5	A-13
	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
A-14	$(\pm) CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$
A-15	$(R) CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$
A-16	$(S) CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$
10	A-17
	$(\pm) CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-18	$(R) CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-19	$(S) CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-20	$(\pm) CH(CH_3)CH(CH_3)_2$
A-21	$(R) CH(CH_3)CH(CH_3)_2$
15	A-22
	$(S) CH(CH_3)CH(CH_3)_2$
A-23	$(CH_2)_5CH_3$
A-24	$(\pm, \pm) CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-25	$(\pm, R) CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_3$
20	A-26
	$(\pm, S) CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_3$
A-27	$(\pm) CH_2CH(CH_3)CF_3$
A-28	$(R) CH_2CH(CH_3)CF_3$
A-29	$(S) CH_2CH(CH_3)CF_3$
25	A-30
	$(\pm) CH_2CH(CF_3)CH_2CH_3$
A-31	$(R) CH_2CH(CF_3)CH_2CH_3$
A-32	$(S) CH_2CH(CF_3)CH_2CH_3$
A-33	$(\pm, \pm) CH(CH_3)CH(CH_3)CF_3$
A-34	$(\pm, R) CH(CH_3)CH(CH_3)CF_3$
30	A-35
	$(\pm, S) CH(CH_3)CH(CH_3)CF_3$
A-36	$(\pm, \pm) CH(CH_3)CH(CF_3)CH_2CH_3$
A-37	$(\pm, R) CH(CH_3)CH(CF_3)CH_2CH_3$
A-38	$(\pm, S) CH(CH_3)CH(CF_3)CH_2CH_3$
35	A-39
	CF_3
A-40	CF_2CF_3
A-41	$CF_2CF_2CF_3$
A-42	$c-C_3H_5$
40	A-43
	$(1-CH_3)-c-C_3H_4$
A-44	$c-C_5H_9$
A-45	$c-C_6H_{11}$
A-46	$(4-CH_3)-c-C_6H_{10}$
45	A-47
	$CH_2C(CH_3)=CH_2$
A-48	$CH_2CH_2C(CH_3)=CH_2$
A-49	$CH_2-C(CH_3)_3$

	Nr.	R ¹
5	A-50	CH ₂ -Si (CH ₃) ₃
	A-51	n-C ₆ H ₁₃
	A-52	(CH ₂) ₃ -CH (CH ₃) ₂
	A-53	(CH ₂) ₂ -CH (CH ₃) -C ₂ H ₅
	A-54	CH ₂ -CH (CH ₃) -n-C ₃ H ₇
10	A-55	CH (CH ₃) -n-C ₄ H ₉
	A-56	CH ₂ -CH (C ₂ H ₅) ₂
	A-57	CH (C ₂ H ₅) -n-C ₃ H ₇
	A-58	CH ₂ -c-C ₅ H ₉
	A-59	CH ₂ -CH (CH ₃) -CH (CH ₃) ₂
15	A-60	CH (CH ₃) -CH ₂ CH (CH ₃) ₂
	A-61	CH (CH ₃) -CH (CH ₃) -C ₂ H ₅
	A-62	CH (CH ₃) -C (CH ₃) ₃
	A-63	(CH ₂) ₂ -C (CH ₃) ₃
	A-64	CH ₂ -C (CH ₃) ₂ -C ₂ H ₅
20	A-65	2-CH ₃ -c-C ₅ H ₈
	A-66	3-CH ₃ -c-C ₅ H ₈
	A-67	C (CH ₃) ₂ -n-C ₃ H ₇
	A-68	(CH ₂) ₆ -CH ₃
	A-69	(CH ₂) ₄ -CH (CH ₃) ₂
25	A-70	(CH ₂) ₃ -CH (CH ₃) -C ₂ H ₅
	A-71	(CH ₂) ₂ -CH (CH ₃) -n-C ₃ H ₇
	A-72	CH ₂ -CH (CH ₃) -n-C ₄ H ₉
	A-73	CH (CH ₃) -n-C ₅ H ₁₁
	A-74	(CH ₂) ₃ C (CH ₃) ₃
30	A-75	(CH ₂) ₂ CH (CH ₃) -CH (CH ₃) ₂
	A-76	(CH ₂)CH (CH ₃) -CH ₂ CH (CH ₃) ₂
	A-77	CH (CH ₃) (CH ₂) ₂ -CH (CH ₃) ₂
	A-78	(CH ₂) ₂ C (CH ₃) ₂ C ₂ H ₅
	A-79	CH ₂ CH (CH ₃) CH (CH ₃) C ₂ H ₅
35	A-80	CH (CH ₃) CH ₂ CH (CH ₃) C ₂ H ₅
	A-81	CH ₂ C (CH ₃) ₂ -n-C ₃ H ₇
	A-82	CH (CH ₃) CH (CH ₃) -n-C ₃ H ₇
	A-83	C (CH ₃) ₂ -n-C ₄ H ₉
	A-84	(CH ₂) ₂ CH (C ₂ H ₅) ₂
40	A-85	CH ₂ CH (C ₂ H ₅) -n-C ₃ H ₇
	A-86	CH (C ₂ H ₅) -n-C ₄ H ₉
	A-87	CH ₂ CH (CH ₃) C (CH ₃) ₃
	A-88	CH (CH ₃) CH ₂ C (CH ₃) ₃

Nr.	R ¹
A-89	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH(CH ₃) ₂
A-90	CH ₂ CH(C ₂ H ₅)CH(CH ₃) ₂
5 A-91	CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
A-92	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-93	CH(C ₂ H ₅)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
A-94	CH(CH ₃)C(CH ₃) ₂ C ₂ H ₅
10 A-95	CH(CH ₃)CH(C ₂ H ₅) ₂
A-96	C(CH ₃) ₂ CH(CH ₃)C ₂ H ₅
A-97	CH(C ₂ H ₅)CH(CH ₃)C ₂ H ₅
A-98	C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-n-C ₃ H ₇
A-99	CH(n-C ₃ H ₇) ₂
15 A-100	CH(n-C ₃ H ₇)CH(CH ₃) ₂
A-101	C(CH ₃) ₂ C(CH ₃) ₃
A-102	C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-CH(CH ₃) ₂
A-103	C(C ₂ H ₅) ₃
20 A-104	(3-CH ₃)-c-C ₆ H ₁₀
A-105	(2-CH ₃)-c-C ₆ H ₁₀
A-106	n-C ₈ H ₁₇
A-107	CH ₂ C(=NO-CH ₃)CH ₃
25 A-108	CH ₂ C(=NO-C ₂ H ₅)CH ₃
A-109	CH ₂ C(=NO-n-C ₃ H ₇)CH ₃
A-110	CH ₂ C(=NO-i-C ₃ H ₇)CH ₃
A-111	CH(CH ₃)C(=NOCH ₃)CH ₃
A-112	CH(CH ₃)C(=NOC ₂ H ₅)CH ₃
30 A-113	CH(CH ₃)C(=NO-n-C ₃ H ₇)CH ₃
A-114	CH(CH ₃)C(=NO-i-C ₃ H ₇)CH ₃
A-115	C(=NOCH ₃)C(=NOCH ₃)CH ₃
A-116	C(=NOCH ₃)C(=NOC ₂ H ₅)CH ₃
35 A-117	C(=NOCH ₃)C(=NO-n-C ₃ H ₇)CH ₃
A-118	C(=NOCH ₃)C(=NO-i-C ₃ H ₇)CH ₃
A-119	C(=NOC ₂ H ₅)C(=NOCH ₃)CH ₃
A-120	C(=NOC ₂ H ₅)C(=NOC ₂ H ₅)CH ₃
40 A-121	C(=NOC ₂ H ₅)C(=NO-n-C ₃ H ₇)CH ₃
A-122	C(=NOC ₂ H ₅)C(=NO-i-C ₃ H ₇)CH ₃
A-123	CH ₂ C(=NO-CH ₃)C ₂ H ₅
A-124	CH ₂ C(=NO-C ₂ H ₅)C ₂ H ₅
45 A-125	CH ₂ C(=NO-n-C ₃ H ₇)C ₂ H ₅
A-126	CH ₂ C(=NO-i-C ₃ H ₇)C ₂ H ₅
A-127	CH(CH ₃)C(=NOCH ₃)C ₂ H ₅

Nr.	R ¹
A-128	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{NOC}_2\text{H}_5)\text{C}_2\text{H}_5$
A-129	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{NO}-n-\text{C}_3\text{H}_7)\text{C}_2\text{H}_5$
5 A-130	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{NO}-n-\text{C}_3\text{H}_7)\text{C}_2\text{H}_5$
A-131	$\text{C}(=\text{NOCH}_3)\text{C}(=\text{NOCH}_3)\text{C}_2\text{H}_5$
A-132	$\text{C}(=\text{NOCH}_3)\text{C}(=\text{NOC}_2\text{H}_5)\text{C}_2\text{H}_5$
A-133	$\text{C}(=\text{NOCH}_3)\text{C}(=\text{NO}-n-\text{C}_3\text{H}_7)\text{C}_2\text{H}_5$
10 A-134	$\text{C}(=\text{NOCH}_3)\text{C}(=\text{NO}-i-\text{C}_3\text{H}_7)\text{C}_2\text{H}_5$
A-135	$\text{C}(=\text{NOC}_2\text{H}_5)\text{C}(=\text{NOCH}_3)\text{C}_2\text{H}_5$
A-136	$\text{C}(=\text{NOC}_2\text{H}_5)\text{C}(=\text{NOC}_2\text{H}_5)\text{C}_2\text{H}_5$
A-137	$\text{C}(=\text{NOC}_2\text{H}_5)\text{C}(=\text{NO}-n-\text{C}_3\text{H}_7)\text{C}_2\text{H}_5$
A-138	$\text{C}(=\text{NOC}_2\text{H}_5)\text{C}(=\text{NO}-i-\text{C}_3\text{H}_7)\text{C}_2\text{H}_5$
15 A-139	$\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-140	$\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-141	$\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-142	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
20 A-143	$\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-144	$\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_2\text{CH}_3$
A-145	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-146	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CH}_2$
25 A-147	$\text{CH}=\text{CH}-n-\text{C}_3\text{H}_7$
A-148	$\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{C}_2\text{H}_5$
A-149	$(\text{CH}_2)_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-150	$(\text{CH}_2)_3-\text{CH}=\text{CH}_2$
30 A-151	$\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-152	$\text{CH}_2-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
A-153	$(\text{CH}_2)_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$
A-154	$\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{C}_2\text{H}_5$
A-155	$\text{CH}_2-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{C}_2\text{H}_5$
35 A-156	$\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-157	$\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-158	$\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-159	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
40 A-160	$\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-161	$\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-162	$\text{C}(=\text{CH}_2)\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
A-163	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)_2$
45 A-164	$\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_3$
A-165	$\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-166	$\text{C}(\text{C}_2\text{H}_5)=\text{CH}-\text{CH}_3$

		Nr.	R ¹
5		A-167	CH (C ₂ H ₅) -CH=CH ₂
		A-168	CH=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
		A-169	CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
		A-170	CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -CH ₃
		A-171	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₃
10		A-172	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
		A-173	CH=CH-CH ₂ -CH (CH ₃) CH ₃
		A-174	CH ₂ -CH=CH-CH (CH ₃) CH ₃
		A-175	CH ₂ -CH ₂ -CH=C (CH ₃) CH ₃
		A-176	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C (CH ₃) =CH ₂
15		A-177	CH=CH-CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₃
		A-178	CH ₂ -CH=C (CH ₃) -CH ₂ -CH ₃
		A-179	CH ₂ -CH ₂ -C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₃
		A-180	CH ₂ -CH ₂ -C (CH ₃) =CH-CH ₃
		A-181	CH ₂ -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH=CH ₂
20		A-182	CH=C (CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
		A-183	CH ₂ -C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
		A-184	CH ₂ -C (CH ₃) =CH-CH ₂ -CH ₃
		A-185	CH ₂ -CH (CH ₃) -CH=CH-CH ₃
		A-186	CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₂ -CH=CH ₂
25		A-187	C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
		A-188	C (CH ₃) =CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
		A-189	CH (CH ₃) -CH=CH-CH ₂ -CH ₃
		A-190	CH (CH ₃) -CH ₂ -CH=CH-CH ₃
		A-191	CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
30		A-192	CH=CH-C (CH ₃) ₃
		A-193	CH=C (CH ₃) -CH (CH ₃) -CH ₃
		A-194	CH ₂ -C (=CH ₂) -CH (CH ₃) -CH ₃
		A-195	CH ₂ -C (CH ₃) =C (CH ₃) -CH ₃
		A-196	CH ₂ -CH (CH ₃) -C (=CH ₂) -CH ₃
35		A-197	C (=CH ₂) -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₃
		A-198	C (CH ₃) =CH-CH (CH ₃) -CH ₃
		A-199	CH (CH ₃) -CH=C (CH ₃) -CH ₃
		A-200	CH (CH ₃) -CH ₂ -C (=CH ₂) -CH ₃
		A-201	CH=C (CH ₂ -CH ₃) -CH ₂ -CH ₃
40		A-202	CH ₂ -C (=CH-CH ₃) -CH ₂ -CH ₃
		A-203	CH ₂ -CH (CH=CH ₂) -CH ₂ -CH ₃
		A-204	C (=CH-CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
		A-205	CH (CH=CH ₂) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃

Nr.	R^1
A-206	$C(CH_2-CH_3)=CH-CH_2-CH_3$
A-207	$CH(CH_2-CH_3)-CH=CH-CH_3$
5	A-208 $CH(CH_2-CH_3)-CH_2-CH=CH_2$
A-209	$CH_2-C(CH_3)_2-CH=CH_2$
A-210	$C(=CH_2)-CH(CH_3)-CH_2-CH_3$
A-211	$C(CH_3)=C(CH_3)-CH_2-CH_3$
10	A-212 $CH(CH_3)-C(=CH_2)-CH_2-CH_3$
A-213	$CH(CH_3)-C(CH_3)=CH-CH_3$
A-214	$CH(CH_3)-CH(CH_3)-CH=CH_2$
A-215	$C(CH_3)_2-CH=CH-CH_3$
A-216	$C(CH_3)_2-CH_2-CH=CH_2$
15	A-217 $C(=CH_2)-C(CH_3)_3$
A-218	$C(=CH-CH_3)-CH(CH_3)-CH_3$
A-219	$CH(CH=CH_2)-CH(CH_3)-CH_3$
A-220	$C(CH_2-CH_3)=C(CH_3)-CH_3$
20	A-221 $CH(CH_2-CH_3)-C(=CH_2)-CH_3$
A-222	$C(CH_3)_2-C(=CH_2)-CH_3$
A-223	$C(CH_3)(CH=CH_2)-CH_2-CH_3$
A-224	$C(CH_3)(CH_2CH_3)-CH_2-CH_2-CH_3$
25	A-225 $CH(CH_2CH_3)-CH(CH_3)-CH_2-CH_3$
A-226	$CH(CH_2CH_3)-CH_2-CH(CH_3)-CH_3$
A-227	$C(CH_3)_2-C(CH_3)_3$
A-228	$C(CH_2-CH_3)-C(CH_3)_3$
A-229	$C(CH_3)(CH_2-CH_3)-CH(CH_3)_2$
30	A-230 $CH(CH(CH_3)_2)-CH(CH_3)_2$
A-231	$CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_3$
A-232	$CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_2-CH_3$
A-233	$CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_2-CH_3$
35	A-234 $CH_2-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_2-CH_3$
A-235	$CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH=CH-CH_3$
A-236	$CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH=CH_2$
A-237	$CH=CH-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_3$
40	A-238 $CH_2-CH=CH-CH_2-CH(CH_3)-CH_3$
A-239	$CH_2-CH_2-CH=CH-CH(CH_3)-CH_3$
A-240	$CH_2-CH_2-CH_2-CH=C(CH_3)-CH_3$
A-241	$CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-C(=CH_2)-CH_3$
45	A-242 $CH=CH-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH_3$
A-243	$CH_2-CH=CH-CH(CH_3)-CH_2-CH_3$
A-244	$CH_2-CH_2-CH=C(CH_3)-CH_2-CH_3$

	Nr .	R ¹
5	A-245	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₃
	A-246	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -C (CH ₃) =CH-CH ₃
	A-247	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH=CH ₂
	A-248	CH=CH-CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-249	CH ₂ -CH=C (CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
10	A-250	CH ₂ -CH ₂ -C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-251	CH ₂ -CH ₂ -C (CH ₃) =CH-CH ₂ -CH ₃
	A-252	CH ₂ -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH=CH-CH ₃
	A-253	CH ₂ -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₂ -CH=CH ₂
	A-254	CH=C (CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
15	A-255	CH ₂ -C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-256	CH ₂ -C (CH ₃) =CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-257	CH ₂ -CH (CH ₃) -CH=CH-CH ₂ -CH ₃
	A-258	CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₂ -CH=CH-CH ₃
	A-259	CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
20	A-260	C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-261	C (CH ₃) =CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-262	CH (CH ₃) -CH=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-263	CH (CH ₃) -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -CH ₃
	A-264	CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₃
25	A-265	CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
	A-266	CH=CH-CH ₂ -C (CH ₃) ₃
	A-267	CH ₂ -CH=CH-C (CH ₃) ₃
	A-268	CH=CH-CH (CH ₃) -CH (CH ₃) ₂
	A-269	CH ₂ -CH=C (CH ₃) -CH (CH ₃) ₂
30	A-270	CH ₂ -CH ₂ -C (=CH ₂) -CH (CH ₃) ₂
	A-271	CH ₂ -CH ₂ -C (CH ₃) =C (CH ₃) ₂
	A-272	CH ₂ -CH ₂ -CH (CH ₃) -C (=CH ₂) -CH ₃
	A-273	CH=C (CH ₃) -CH ₂ -CH (CH ₃) ₂
	A-274	CH ₂ -C (=CH ₂) -CH ₂ -CH (CH ₃) ₂
35	A-275	CH ₂ -C (CH ₃) =CH-CH (CH ₃) ₂
	A-276	CH ₂ -CH (CH ₃) -CH=C (CH ₃) ₂
	A-277	CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₂ -C (=CH ₂) -CH ₃
	A-278	C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₂ -CH (CH ₃) ₂
	A-279	C (CH ₃) =CH-CH ₂ -CH (CH ₃) ₂
40	A-280	CH (CH ₃) -CH=CH-CH (CH ₃) ₂
	A-281	CH (CH ₃) -CH ₂ -CH=C (CH ₃) ₂
	A-282	CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -C (=CH ₂) -CH ₃
	A-283	CH=CH-C (CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₃

	Nr.	R ¹
5	A-284	CH ₂ -CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH=CH ₂
	A-285	CH=C(CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
	A-286	CH ₂ -C(=CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
	A-287	CH ₂ -C(CH ₃)=C(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
	A-288	CH ₂ -CH(CH ₃)-C(=CH ₂)-CH ₂ -CH ₃
10	A-289	CH ₂ -CH(CH ₃)-C(CH ₃)=CH-CH ₃
	A-290	CH ₂ -CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-CH=CH ₂
	A-291	C(=CH ₂)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
	A-292	C(CH ₃)=CH-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
	A-293	CH(CH ₃)-CH=C(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
15	A-294	CH(CH ₃)-CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -CH ₃
	A-295	CH(CH ₃)-CH ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₃
	A-296	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH=CH ₂
	A-297	CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH=CH-CH ₃
	A-298	CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
20	A-299	C(=CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-300	C(CH ₃)=C(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-301	CH(CH ₃)-C(=CH ₂)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-302	CH(CH ₃)-C(CH ₃)=CH-CH ₂ -CH ₃
	A-303	CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-CH=CH-CH ₃
25	A-304	CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH=CH ₂
	A-305	C(CH ₃) ₂ -CH=CH-CH ₂ -CH ₃
	A-306	C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₃
	A-307	C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
	A-308	CH=CH-CH(CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
30	A-309	CH ₂ -CH=C(CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
	A-310	CH ₂ -CH ₂ -C(=CH-CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
	A-311	CH ₂ -CH ₂ -CH(CH=CH ₂)-CH ₂ -CH ₃
	A-312	CH=C(CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-313	CH ₂ -C(=CH-CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
35	A-314	CH ₂ -CH(CH=CH ₂)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-315	CH ₂ -C(CH ₂ -CH ₃)=CH-CH ₂ -CH ₃
	A-316	CH ₂ -CH(CH ₂ -CH ₃)-CH=CH-CH ₃
	A-317	CH ₂ -CH(CH ₂ -CH ₃)-CH-CH=CH ₂
	A-318	C(=CH-CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
40	A-319	CH(CH=CH ₂)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-320	C(CH ₂ -CH ₃)=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-321	CH(CH ₂ -CH ₃)-CH=CH-CH ₂ -CH ₃
	A-322	CH(CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH=CH-CH ₃

Nr.	R ¹
A-323	CH(CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
A-324	C(=CH-CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
5 A-325	C(CH=CH-CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
A-326	C(CH ₂ -CH=CH ₂)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
A-327	CH=C(CH ₃)-C(CH ₃) ₃
A-328	CH ₂ -C(=CH ₂)-C(CH ₃) ₃
10 A-329	CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH(=CH ₂)-CH ₃
A-330	C(=CH ₂)-CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₃
A-331	C(CH ₃)=C(CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₃
A-332	CH(CH ₃)-C(=CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₃
A-333	CH(CH ₃)-C(CH ₃)=C(CH ₃)-CH ₃
15 A-334	CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-C(=CH ₂)-CH ₃
A-335	C(CH ₃) ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₃
A-336	C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -C(=CH ₂)-CH ₃
A-337	C(CH ₃) ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -CH ₃
20 A-338	C(CH ₃) ₂ -C(CH ₃)=CH-CH ₃
A-339	C(CH ₃) ₂ -CH(CH ₃)CH=CH ₂
A-340	CH(CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₃
A-341	CH(CH ₂ -CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
25 A-342	C(CH ₃)(CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
A-343	CH(i-C ₃ H ₇)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
A-344	CH=C(CH ₂ -CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₃
A-345	CH ₂ -C(=CH-CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₃
A-346	CH ₂ -CH(CH=CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₃
30 A-347	CH ₂ -C(CH ₂ -CH ₃)=C(CH ₃)-CH ₃
A-348	CH ₂ -CH(CH ₂ -CH ₃)-C(=CH ₂)-CH ₃
A-349	CH ₂ -C(CH ₃)(CH=CH ₂)-CH ₂ -CH ₃
A-350	C(=CH ₂)-CH(CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
35 A-351	C(CH ₃)=C(CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
A-352	CH(CH ₃)-C(=CH-CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
A-353	CH(CH ₃)-CH(CH=CH ₂)-CH ₂ -CH ₃
A-354	CH=C(CH ₂ -CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₃
40 A-355	CH ₂ -C(=CH-CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₃
A-356	CH ₂ -CH(CH=CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₃
A-357	CH ₂ -C(CH ₂ -CH ₃)=C(CH ₃)-CH ₃
A-358	CH ₂ -CH(CH ₂ -CH ₃)-C(=CH ₂)-CH ₃
A-359	C(=CH-CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₃
45 A-360	CH(CH=CH ₂)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₃
A-361	C(CH ₂ -CH ₃)=CH-CH(CH ₃)-CH ₃

Nr.	R ¹
A-362	$\text{CH}(\text{CH}_2-\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$
A-363	$\text{CH}(\text{CH}_2-\text{CH}_3)\text{CH}_2-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_3$
5 A-364	$\text{C}(=\text{CH}-\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-365	$\text{CH}(\text{CH}=\text{CH}_2)\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-366	$\text{C}(\text{CH}_2-\text{CH}_3)=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-367	$\text{CH}(\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
10 A-368	$\text{CH}(\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-369	$\text{CH}(\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-370	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}=\text{CH}_2)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-371	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$
A-372	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2-\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$
15 A-373	$\text{C}[=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3]-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-374	$\text{CH}[\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_3]-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-375	$\text{C}(\text{i}-\text{C}_3\text{H}_7)=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$
A-376	$\text{CH}(\text{i}-\text{C}_3\text{H}_7)-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_3$
20 A-377	$\text{CH}(\text{i}-\text{C}_3\text{H}_7)-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$
A-378	$\text{C}(=\text{CH}-\text{CH}_3)-\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-379	$\text{CH}(\text{CH}=\text{CH}_2)-\text{C}(\text{CH}_3)_3$
A-380	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}=\text{CH}_2)\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$
25 A-381	$\text{C}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2-\text{CH}_3)\text{C}(=\text{CH}_2)-\text{CH}_3$
A-382	2-CH ₃ -Cyclohex-1-enyl
A-383	[2-(=CH ₂)]-c-C ₆ H ₉
A-384	2-CH ₃ -Cyclohex-2-enyl
A-385	2-CH ₃ -Cyclohex-3-enyl
30 A-386	2-CH ₃ -Cyclohex-4-enyl
A-387	2-CH ₃ -Cyclohex-5-enyl
A-388	2-CH ₃ -Cyclohex-6-enyl
A-389	3-CH ₃ -Cyclohex-1-enyl
35 A-390	3-CH ₃ -Cyclohex-2-enyl
A-391	[3-(=CH ₂)]-c-C ₆ H ₉
A-392	3-CH ₃ -Cyclohex-3-enyl
A-393	3-CH ₃ -Cyclohex-4-enyl
40 A-394	3-CH ₃ -Cyclohex-5-enyl
A-395	3-CH ₃ -Cyclohex-6-enyl
A-396	4-CH ₃ -Cyclohex-1-enyl
A-397	4-CH ₃ -Cyclohex-2-enyl
45 A-398	4-CH ₃ -Cyclohex-3-enyl
A-399	[4-(=CH ₂)]-c-C ₆ H ₉

27

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Phycomyceten* und *Basidiomyceten*,
 5 aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen,
 10 Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

15 Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
 - *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
 - 20 • *Cercospora arachidicola* an Erdnüssen,
 - *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
 - *Erysiphe graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
 - *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
 - 25 • *Helminthosporium*-Arten an Getreide,
 - *Mycosphaerella*-Arten an Bananen und Erdnüssen,
 - *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
 - *Plasmopara viticola* an Reben,
 - *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
 - 30 • *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
 - *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
 - *Puccinia*-Arten an Getreide,
 - *Pyricularia oryzae* an Reis,
 - *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
 - 35 • *Septoria nodorum* an Weizen,
 - *Uncinula necator* an Reben,
 - *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
 - *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.
- 40 Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.
- 45 Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirk-

28

stoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

- 5 Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

15

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nicht-ionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

45

29

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenoether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyletheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Silicagel, Kieselsäuren, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

5

Beispiele für Formulierungen sind:

- I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 10 II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).
- 15 III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlage-
- 20 rungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).
- 25 IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).
- 30 V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-alpha-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer
- 35 Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).
- 40 VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl- α -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).
- 45

31

- VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Lignin-sulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 20 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.
- 30 Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.
- 40 Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.
- 45

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

5

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

- Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisdithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zinkethylen-diamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylenbis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylenbis-(thiocarbamoyl)disulfid;
- Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäure-di-isopropylester;
- heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2-Chlor-N-(4'-chlor-biphenyl-2-yl)-nicotinamid, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethyl-phthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid,
- N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäurediamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanme-

- thylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol,
 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazonon,
 Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfer-
 salz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin,
 5 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid,
 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methyl-
 furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäure-
 anilid, 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dime-
 thyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-me-
 10 thoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoesäu-
 re-anilid, 2-Iod-benzoesäure-anilid, N-Formyl-N-morpho-
 lin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-1-
 (2,2,2-trichlorethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-for-
 mylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin
 15 bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw.
 dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpro-
 pyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin, N-[3-(p-tert.-Butylphe-
 nyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlor-
 phenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol,
 20 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-
 ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphen-
 oxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-di-
 methyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphen-
 oxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol,
 25 (2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)-oxiran-2-ylme-
 thyl]-1H-1,2,4-triazol, α -(2-Chlorphenyl)- α -(4-chlorphe-
 nyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydro-
 xy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol,
 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
 30 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
 • Strobilurine wie Methyl-E-methoxyimino-[α -(o-tolyloxy)-o-to-
 lyll]acetat, Methyl-E-2-{2-[6-(2-cyanophenoxy)-pyrimidin-4-yl-
 oxy]-phenyl}-3-methoxyacrylat, Methyl-E-methoxyimino-[α -(2-
 phenoxyphenyl)]-acetamid, Methyl-E-methoxyimino-[α -(2,5-dime-
 35 thylphenoxy)-o-tolyl]-acetamid, Methyl-E-2-{2-[2-trifluorme-
 thylpyridyl-6-]oxymethyl}-phenyl}-3-methoxyacrylat, (E,E)-Metho-
 ximino-{2-[1-(3-trifluormethylphenyl)-ethylidenaminooxyme-
 thyl]-phenyl}-essigsäuremethylester, Methyl-N-(2-{[1-(4-chlor-
 phenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxymethyl}phenyl)N-methoxy-carbammat,
 40 • Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin,
 N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-[4-Me-
 thyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin,
 • Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyr-
 rol-3-carbonitril,
 45 • Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphe-
 nyl)-acrylsäuremorpholid, 3-(4-Fluorphenyl)-3-(3,4-dimethoxy-
 phenyl)-acrylsäuremorpholid,

34

- sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 1-(3-Brom-6-methoxy-2-methyl-phenyl)-1-(2,3,4-trimethoxy-6-methyl-phenyl)-methanon, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methylester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alaninmethylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylhydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonsäureimid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbonyl)-2-methoximino]-acetamid, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pentyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Difluor- α -(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalkohol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol, 5-Chlor-2-cyano-4-p-tolyl-imidazol-1-sulfonsäuredimethylamid, 3,5-Dichlor-N-(3-chlor-1-ethyl-1-methyl-2-oxo-propyl)-4-methylbenzamid.

Synthesebeispiele

- 25 Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Angaben aufgeführt.

30

Beispiel 1 Herstellung von 5,7-Dimethyl-6-phenyl-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [I-1]

- Eine Mischung von 0,84 g (10 mmol) 3-Aminotriazol und 1,8 g (28 mmol) 3-Phenyl-pentandion-(2,4) in 5 g Tributylamin wurde 8 Std. bei 140°C bis 180°C erhitzt. Nach Abkühlen auf 20 bis 25°C wurde der Niederschlag abfiltriert und mit Diisopropylether gewaschen. Man erhielt 0,3 g der Titelverbindung als farblose Kristalle. Das Filtrat wurde mit verd. Salzsäure extrahiert und die organische Phase wurde verworfen. Nach Neutralisation wurde die wässrige Phase mit Essigester extrahiert und eingengt. Aus dem Rückstand wurde nach Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan/Essigester-Gemische) zusätzlich 0,5 g (insgesamt 36 %) der Titelverbindung als gelbliche Kristallmasse erhalten.

45

35

¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8,5 (s, 1H); 7,5 (m, 3H); 7,2 (m, 2H); 2,6 (s, 3H); 2,45 (s, 3H).

Beispiel 2 Herstellung von 7-Cyclohexyl-5-methyl-6-(2-Cl-,6-F-phenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [I-4]

- a) 7-Cyclohexyl-5-(diethylmalon-2-yl)-6-(2-Cl-,6-F-phenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin
- 10 Eine Mischung von 30 g (0,18 mol) Malonsäurediethylester in 30 ml Acetonitril wurde mit 0,3 g (12 mmol) Natriumhydrid versetzt. Anschließend gab man 2,8 g (7,6 mmol) 5-Chlor-7-cyclohexyl-6-(2-Cl-,6-F-phenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin (WO-A 99/41255) hinzu und rührte die Reaktionsmischung ca. 5 Std. bei etwa 70°C.
- 15 Dabei fielt das Natriumsalz des Produktes als gelber Festkörper aus, der abfiltriert und mit Acetonitril gewaschen wurde. Der Rückstand wurde mit etwas Kieselgur vermengt und mit einer Mischung aus verd. Salzsäure und Essigester gerührt. Die Acetonitril-Waschphase wurde ebenfalls mit verd. Salzsäure/Essigester
- 20 gerührt. Die vereinigten Essigester-Phasen wurden getrocknet und eingeengt. Der Rückstand kristallisierte und wurde mit Diisopropylether digeriert. Man erhielt 1,4 g (38 %) der Titelverbindung als farblosen Festkörper.

25 ¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8,55 (s, 1H); 7,5 (m, 2H); 7,2 (t, 1H); 4,6 (s, 1H); 4,0 - 4,4 (m, 4H); 2,3 - 2,9 (m, 3H); 1,6 - 1,9 (m, 5H); 1,05 - 1,4 (m, 9H).

- b) 7-Cyclohexyl-5-methyl-6-(2-Chlor-,6-fluor-phenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin
- 30

Eine Mischung von 1,1 g (2,2 mmol) 7-Cyclohexyl-5-(diethylmalon-2-yl)-6-(2-Cl-,6-F-phenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin (Beispiel 2a) in 10 ml konz. Salzsäure wurde 2 Stunden bei 80 bis

35 90°C gerührt. Nach Abkühlen auf 20 bis 25°C wurde mit Wasser verdünnt und die wässrige Phase mit CH₂Cl₂ extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Natriumcarbonat-Lsg. gewaschen, getrocknet und eingeengt. Der Rückstand kristallisierte und wurde mit Diisopropylether digeriert. Man erhielt 0,5 g (66 %) der Titelverbindung als farblosen Festkörper vom Fp. 182 bis 184°C.

40

¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8,5 (s, 1H); 7,5 (m, 2H); 7,2 (t, 1H); 2,2 - 2,9 (m, 3H); 2,6 (s, 3H); 1,6 - 1,9 (m, 5H); 1,15 - 1,4 (m, 3H).

36

Beispiel 3 Herstellung von 7-Isobutyl-5-ethyl-6-(2-Cl-,6-F-phenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [I-14]

Durch eine Mischung von 1,7 g (5 mmol) 5-Cl-7-isobutyl-6-
5 (2-Cl-,6-F-phenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin (WO-A 99/41255)
in 40 ml Tetrahydrofuran wurde ca. 15 min ein Argonstrom geleitet. Anschließend gab man 0,15 g (0,25 mmol) (1,3-Bis-(diphenylphosphino)-propan)-nickel-II-chlorid und 0,75 g (6 mmol) Diethylzink hinzu und rührte ca. 3 Std. bei 20 bis 25°C. Die Reaktionsmischung wurde mit Wasser verdünnt und mit CH₂Cl₂ extrahiert. Die
10 vereinigten organischen Phasen wurden getrocknet und eingeeengt. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel (RP 18) mit Cyclohexan/Essigester-Gemischen 0,2 g (12 %) der Titelverbindung als farblosen Festkörper vom Fp. 106 - 108°C.
15
¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8,5 (s, 1H); 7,5 (m, 1H); 7,45 (d, 1H); 7,2 (t, 1H); 3,05 (dd, 1H); 2,7 (m, 3H); 2,3 (m, 1H); 1,25 (t, 3H); 0,9 (d, 3H); 0,8 (d, 3H).

20

25

30

35

40

45

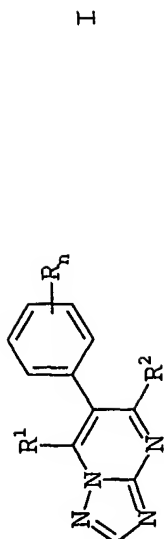


Tabelle I: Verbindungen der Formel I

Nr.	R ¹	R ²	R _n	Physikalische Daten (Fp. [°C], IR [cm ⁻¹], ¹ H-NMR [ppm])
I-1	CH ₃	CH ₃	-	8,5 (s, 1H); 7,5 (m, 3H); 7,2 (m, 2H); 2,6 (s, 3H); 2,5 (s, 3H)
I-2	CH ₃	CH ₃	2-Cl, 6-F	117-121
I-3	(4-CH ₃)-C-C ₆ H ₁₀	CH ₃	2-Cl, 6-F	190-192
I-4	C-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2-Cl, 6-F	182-184
I-5	C-C ₅ H ₉	CH ₃	2-Cl, 6-F	179-181
I-6	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	2-Cl, 6-F	96-98
I-7	C-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,4,6-F ₃	159-161
I-8	(CH ₂) ₃ Cl	CH ₃	2-Cl, 6-F	96-98
I-9	(1-CH ₃)-C-C ₃ H ₄	CH ₃	2-Cl, 6-F	176-178
I-10	C-C ₃ H ₅	CH ₃	2-Cl, 6-F	8,4 (s, 1H); 7,5 (m, 2H); 7,3 (t, 1H); 2,4 (s, 3H); 2,8 (m, 3H); 1,1 (m, 2H)
I-11	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	2-Cl, 6-F	154-155
I-12	C ₆ H ₅	CH ₃	2-Cl, 6-F	215-217
I-13	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	2-Cl, 6-F	166-168

Nr.	R ¹	R ²	R _n	Physikalische Daten (Fp. [°C], IR [cm ⁻¹], ¹ H-NMR [ppm])
I-14	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl, 6-F	106-108
I-15	(S) CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃	2-Cl, 6-F	99-101
I-16	CH ₂ -C(=NO-CH ₂ -C ₆ H ₅)-CH ₃	CH ₃	2, 6-F ₂ , 4-OCH ₃	1640, 1616, 1597, 1578, 1518, 101, 1440, 1275, 1200, 1191, 1151, 1137, 1122, 1042, 999
I-17	CH ₂ -C(=NO-CH ₃)-CH ₃	CH ₃	2, 4, 6-F ₃	1639, 1618, 1597, 1518, 1498, 1439, 1397, 1276, 1238, 1190, 1123, 1055, 1041, 999, 848
I-18	CH ₂ -C(=NO-C ₂ H ₅)-CH ₃	CH ₃	2, 4, 6-F ₃	1638, 1617, 1597, 1518, 1498, 1439, 1397, 1276, 1238, 1191, 1123, 1052, 1041, 999
I-19	CH ₂ -C(=NO-i-C ₃ H ₇)-CH ₃	CH ₃	2, 4, 6-F ₃	8,5 (2s); 4,1, 3,9 (2s); 2,5 (s); 1,8, 1,6 (2s)
I-20	CH ₂ -C(=NO-CH ₃)-C ₂ H ₅	CH ₃	2, 4, 6-F ₃	8,5 (s); 4,1, 3,95 (2s); 2,5 (2s); 1,0, 0,85 (2t)
I-21	CH ₃	CH ₃	2, 4, 6-F ₃	148
I-22	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	CH ₃	2, 4, 6-F ₃	142
I-23	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	CH ₃	2, 4, 6-F ₃	119
I-24	CH ₃	CH ₃	2,6-F ₂ , 4-O(CH ₂) ₂ CH ₃	59
I-25	n-C ₄ H ₉	CH ₃	2, 4, 6-F ₃	2961, 1638, 1614, 1596, 120, 1498, 1438, 1397, 1274, 1238, 1122, 1039, 999, 843, 531

Nr.	R ¹	R ²	R _n	Physikalische Daten (Fp. [°C], IR [cm ⁻¹], ¹ H-NMR [ppm])
I-26	(S) CH ₂ CH(CH ₃)C ₂ H ₅	CH ₃	2,4,6-F ₃	2964, 1638, 1610, 1596, 1516, 1498, 1438, 1277, 1238, 1192, 1122, 1039, 999, 843, 531
I-27	c-C ₃ H ₅	CH ₂ CO-OC ₂ H ₅	2-Cl,6-F	1738, 1601, 1568, 1511, 1467, 1447, 1317, 1284, 1248, 1189, 1157, 1034, 981, 895, 789
I-28	c-C ₅ H ₉	CH ₃	2,6-F ₂ ,4-CO-OCH ₃	129
I-29	(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃) ₂	CH ₃	2,4,6-F ₃	8,5 (s); 6,9 (m); 2,95 (m); 2,5 (s)
I-30	n-C ₄ H ₉	CH ₃	2,6-F ₂	127
I-31	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	2,6-F ₂	107
I-32	n-C ₅ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂	98
I-33	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	2,6-F ₂	138
I-34	CH(C ₂ H ₅) ₂	CH ₃	2,6-F ₂	160
I-35	c-C ₅ H ₉	CH ₃	2,6-F ₂	192
I-36	n-C ₆ H ₁₃	CH ₃	2,6-F ₂	8,5 (s); 7,5 (m); 7,1 (m); 3,0 (m); 2,5 (s)
I-37	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂	192
I-38	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	CH ₃	2,6-F ₂	163
I-39	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	CH ₃	2,4,6-F ₃	120
I-40	(CH ₂) ₂ CH(Cl)CH ₃	CH ₃	2,4,6-F ₃	75
I-41	n-C ₄ H ₉	CH ₃	2,6-F ₂	128
I-42	n-C ₆ H ₁₃	CH ₃	2,6-F ₂	148

Nr.	R ¹	R ²	R _n	Physikalische Daten (Fp. [°C], IR [cm ⁻¹], ¹ H-NMR [ppm])
I-43	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	CH ₃	2,6-F ₂	135
I-44	n-C ₅ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂	102
I-45	CH(C ₂ H ₅) ₂	CH ₃	2,6-F ₂	175
I-46	CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	2,6-F ₂	132
I-47	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2-CH ₃ ,4-F	8,5 (s); 2,3 (s); 2,1 (s)
I-48	c-C ₅ H ₉	CH ₃	2,6-F ₂ ,4-OH	299
I-49	CF ₃	CH ₃	2,4,6-F ₃	131
I-50	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ ,4-OCH ₃	185
I-51	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ ,4-OCH ₂ CH ₃	8,5 (s); 6,65 (m); 4,1 (q); 2,5 (s)
I-52	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ , 4-O-n-C ₃ H ₇	108
I-53	(4-CH ₃)-c-C ₆ H ₁₀	CH ₃	2,4,6-F ₃	131
I-54	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ , 4-O-i-C ₃ H ₇	212
I-55	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ ,4-OH	290
I-56	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ ,4-CH=CH ₂	207
I-57	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ ,4-C ₂ H ₅	180
I-58	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ ,4-CN	202
I-59	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ ,4-OCHF ₂	165
I-60	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ , 4-OCH ₂ CO ₂ CH ₃	8,5 (s); 6,65 (m); 4,7 (s); 3,9 (s); 2,45 (s)

Nr.	R ¹	R ²	R _n	Physikalische Daten (Fp. [°C], IR [cm ⁻¹], ¹ H-NMR [ppm])
I-61	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ , 4-OCH ₂ CH(OCH ₃) ₂	109
I-62	CH ₂ CH(CH ₃)C ₂ H ₅	CH ₃	2-F,4-CH ₃	8,45 (s); 7,1 (m); 3,05 (m); 2,8 (m); 2,45 (s); 2,4 (s)
I-63	CH ₂ CH(CH ₃)C ₂ H ₅	CH ₃	4-F,2-CH ₃	120
I-64	(CH ₂) ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	2,4,6-F ₃	72
I-65	CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	2,4,6-F ₃	1639, 1611, 1598, 1518, 1496, 1439, 1280, 11213, 1201, 1123, 1036, 1000, 917, 844, 661
I-66	CH ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	2,6-F ₂ ,4-OCH ₃	82
I-67	n-C ₅ H ₁₁	CH ₃	2,4,6-F ₃	2959, 2932, 1638, 1612, 1596, 1519, 1498, 1438, 1397, 1278, 1192, 1122, 1039, 999, 843
I-68	n-C ₆ H ₁₃	CH ₃	2,4,6-F ₃	2957, 2931, 1638, 1610, 1597, 1519, 1498, 1438, 1397, 1277, 1239, 1192, 1122, 1039, 1000
I-69	CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	2,4,6-F ₃	118
I-70	(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂	CH ₃	2,4,6-F ₃	8,5 (s); 6,9 (m); 2,5 (s); 0,8 (d)
I-71	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)C ₂ H ₅	CH ₃	2,4,6-F ₃	8,5 (s); 6,9 (m); 2,9 (m); 2,5 (s)
I-72	CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -CH ₃	CH ₃	2,4,6-F ₃	8,5 (s); 6,9 (t); 3,0 (dd); 2,8 (dd); 2,5 (s)
I-73	CH(CH ₃)-n-C ₄ H ₉	CH ₃	2,4,6-F ₃	111
I-74	CH ₂ CH(C ₂ H ₅) ₂	CH ₃	2,4,6-F ₃	90

Nr.	R ¹	R ²	R _n	Physikalische Daten (Fp. [°C], IR [cm ⁻¹], ¹ H-NMR [ppm])
I-75	CH(C ₂ H ₅)-n-C ₃ H ₇	CH ₃	2,4,6-F ₃	110
I-76	2-(CH ₃)-c-C ₃ H ₄ (Diastereomer 1)	CH ₃	2,4,6-F ₃	92
I-77	2-(CH ₃)-c-C ₃ H ₄ (Diastereomer 2)	CH ₃	2,4,6-F ₃	125
I-78	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2-F,4-CH ₃	176
I-79	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃	2,4,6-F ₃	103
I-80	CH(CH ₃)COCH ₃	CH ₃	2,4,6-F ₃	165
I-81	CH ₂ -CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃	2,4,6-F ₃	81
I-82	4-CH ₃ -cyclohex-3-en-1-yl	CH ₃	2,4,6-F ₃	178
I-83	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ , 4-CH=C(CH ₃) ₂	145
I-84	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	CO-NH ₂	231
I-85	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	2,4,6-F ₃	2962, 1638, 1610, 1596, 1516, 1497, 1438, 1396, 1276, 1238, 1192, 1122, 1039, 999, 843
I-86	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ , 4-CH=CH-CH(OCH ₃) ₂	8,45 (s); 7,1 (d); 6,75 (d); 6,3 (dd); 5,05 (d); 3,45 (s); 2,4 (s)
I-87	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ ,4-OCN	182
I-88	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ ,4-COCH ₃	170
I-89	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ , 4-C(=NOCH ₃)CH ₃	2931, 1936, 1607, 1559, 1508, 1498, 1449, 1416, 1352, 1274, 1237, 1057, 1037, 873, 660

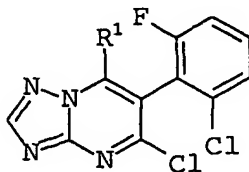
Nr.	R ¹	R ²	R _n	Physikalische Daten (Fp. [°C], IR [cm ⁻¹], ¹ H-NMR [ppm])
I-90	C-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ , 4-C(=NOC ₂ H ₅)CH ₃	2932, 1607, 1557, 1509, 1497, 1453, 1443, 1417, 1351, 1279, 1049, 1036, 1003, 877, 660
I-91	C(CH ₃)=NOCH ₃	CH ₃	2-Cl, 6-F	117
I-92	C(CH ₃)=NO-n-C ₄ H ₉	CH ₃	2-Cl, 6-F	2960, 2933, 1601, 1525, 1469, 1448, 1273, 1248, 1238, 1066, 1033, 893, 879, 785, 657
I-93	C(CH ₃)=NO-n-C ₃ H ₇	CH ₃	2-Cl, 6-F	100
I-94	C(CH ₃)=NOC ₂ H ₅	CH ₃	2-Cl, 6-F	94

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I
5 ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als 10%ige Emulsion
in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil®
LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung
10 auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Wettol®
EM (nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ri-
cinusöl) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentra-
tion mit Wasser verdünnt.

15 Als Vergleichswirkstoffe dienten die aus WO-A 99/41255 bekannten
Verbindungen A bis F:



20

Nr.	bekannt aus	R ¹
A	WO-A 99/41255, Nr.2c	4-CH ₃ -c-C ₆ H ₁₀
25 B	WO-A 99/41255, Nr.26	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
C	WO-A 99/41255, Nr.27	CH(CH ₃) ₂
D	WO-A 99/41255, Nr.29	c-C ₅ H ₉
E	WO-A 99/41255, Nr.30	c-C ₇ H ₁₃
30 F	WO-A 99/41255, Nr.31	C ₆ H ₅

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen *Alternaria solani* an Tomaten

35 Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Große Fleischtomate St.
Pierre" wurden mit einer wäßrigen Suspension, die aus einer
Stammlösung aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emul-
giermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. Am fol-
genden Tag wurden die Blätter mit einer wäßrigen Zoosporenauf-
40 schwemmung von *Alternaria solani* in 2 % Biomalzlösung mit einer
Dichte von 0,17 x 10⁶ Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die
Pflanzen in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei Temperaturen
zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die
Krautfäule auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontroll-
45 pflanzen so stark entwickelt, daß der Befall visuell in % ermit-
telt werden konnte.

45

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Wirkstoffe I-3 bis I-8, I-11 bis I-15, I-18, I-20, I-22, I-23, I-25, I-26, I-28 bis I-32, I-35 bis I-37, I-40, I-41, I-42, I-44, I-47, I-48, I-50 bis I-54, I-56, I-58, I-59, I-61, I-62, I-64 und I-67 bis I-74 der Tabelle I behandelten Pflanzen maximal 10 % Befall, während die mit 63 ppm der Vergleichswirkstoffe C und D behandelten zu mindestens 80 % und die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

10 Anwendungsbeispiel 2 - Protektive Wirksamkeit gegen Gurkenmehltau

Blätter von in Töpfen gewachsenen Gurkenkeimlingen der Sorte "Chinesische Schlange" wurden im Keimblattstadium mit wäßriger Wirkstoffaufbereitung, die mit einer Stammlösung aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. 20 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension des Gurkenmehltaus (*Sphaerotheca fuliginea*) inokuliert. Anschließend wurden die Pflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 60 bis 80 % relativer Luftfeuchtigkeit für 7 Tage kultiviert. Dann wurde das Ausmaß der Mehltauentwicklung visuell in %-Befall der Keimblattfläche ermittelt.

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Wirkstoffe I-3 bis I-9, I-11 bis I-15, I-17, I-18, I-20, I-22, I-23, I-25, I-26, I-28 bis I-32, I-34, I-35, I-37, I-38, I-40, I-41, I-43, I-46, I-47, I-52, I-53, I-58, I-63, I-64, I-66 bis I-75, I-93 und I-94 der Tabelle I behandelten Pflanzen keinen oder bis maximal 10 % Befall, während die mit 63 ppm der Vergleichswirkstoffe A bis F behandelten zu mindestens 60 % und die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 3 - Protektive Wirksamkeit gegen die Netzfleckenkrankheit der Gerste (*Pyrenophora teres*)

Blätter von in Töpfen gewachsenen Gerstenkeimlingen der Sorte "Igri" wurden mit wäßriger Wirkstoffaufbereitung, die aus einer Stammlösung bestehend aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht und 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages mit einer wäßrigen Sporensuspension von *Pyrenophora teres*, dem Erreger der Netzfleckenkrankheit inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 95 bis 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Nach 6 Tagen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

46

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Wirkstoffe I-3 bis I-8, I-11, I-12, I-14, I-15, I-18, I-22, I-23, I-25, I-26, I-28 bis I-32, I-35, I-36, I-37, I-40 bis I-44, I-47, I-50 bis I-53, I-58, I-61 bis I-64, I-66 bis I-74 und I-77 der Tabelle I behandelten 5 Pflanzen maximal 20 % Befall, während die mit mit 63 ppm der Vergleichswirkstoffe B, D und F behandelten zu mindestens 60 % und die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

10

15

20

25

30

35

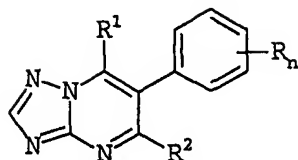
40

45

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel I

5



I

10 in der der Index und die Substituenten folgende Bedeutung haben:

n 0 oder eine ganze Zahl von 1 bis 5;

- 15 R Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanato (OCN), C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₁₀-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkinyloxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkoxy, C₁-C₈-Alkoxycarbo-
- 20 nyl, C₂-C₁₀-Alkenyloxycarbonyl, C₂-C₁₀-Alkinyloxycarbonyl, Aminocarbonyl, C₁-C₈-Alkylaminocarbonyl, Di-(C₁-C₈-)alkylaminocarbonyl, C₁-C₈-Alkoximinoalkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl-
- 25 oximinocarbonyl, C₂-C₁₀-Alkinyloximinocarbonyl, C₁-C₈-Alkylcarbonyl, C₂-C₁₀-Alkenylcarbonyl, C₂-C₁₀-Alkynylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkylcarbonyl, oder ein fünf- bis zehngliederiger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S;
- 30 R¹ C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliederiger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

35

wobei R und/oder R¹ partiell oder vollständig halogeniert oder durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a substituiert sein können:

- 40 R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-
- 45 carbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkoximino, C₂-C₁₀-Alkenyloximino, C₂-C₁₀-Alkinyloximino, Aryl-C₁-C₈-alkyloximino, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₂-C₁₀-Alke-

48

nyloxy-carbonyl, C₂-C₁₀-Alkinyloxy-carbonyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

5

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

10

R^b Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxy, Alkoxy-carbonyl, Alkyl-carbo-nyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothio-carbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

15

20

und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

25

Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocycl-yloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C₁-C₆-alkoxy, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetaryl-reste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können; und

30

35

R² C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl oder C₂-C₄-Alkinyl, die durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₂-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sein können.

40

2. Triazolopyrimidine der Formel I gemäß Anspruch 1, in der der Index und die Substituenten folgende Bedeutung haben:

n 0 oder eine ganze Zahl von 1 bis 5;

45

- 5 R Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkyl-
nyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₁₀-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alk-
oxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkinyloxy, C₁-C₆-Haloge-
nalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Cy-
cloalkoxy oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter,
partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus,
enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N
oder S;
- 10 R¹ C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkynyl, C₃-C₁₀-Cyclo-
alkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein
fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesät-
tigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis
vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,
- 15 wobei R¹ partiell oder vollständig halogeniert oder durch
eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a sub-
stituiert sein kann:
- 20 R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl,
C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cyclo-
alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alk-
oxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-
C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy,
25 C₃-C₆-Alkinyloxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl,
fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell unge-
sättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend
ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,
- 30 wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromati-
schen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halo-
geniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können,
und
- 35 R² C₁-C₄-Alkyl, das durch Halogen, Cyano, Nitro oder
C₁-C₂-Alkoxy substituiert sein kann.
3. Triazolopyrimidine der Formel I gemäß Anspruch 1, in der der
Index und die Substituenten die folgenden Bedeutungen haben:
- 40 n eine ganze Zahl von 1 bis 3;
- R Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy,
C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkox-
45 imino-C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-Alkenyloximino-C₁-C₆-alkyl,
C₂-C₆-Alkinyloximino-C₁-C₆-alkyl;

50

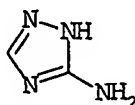
R¹ C₃-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Alkenyl, C₃-C₈-Alkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₅-C₆-Cycloalkenyl;

5 R^a Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoximino, C₂-C₆-Alkenyloximino, C₂-C₆-Alkinyloximino;

10 R^c Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₆-Alkoxy;

15 R² C₁-C₄-Alkyl, das durch Halogen substituiert sein kann.

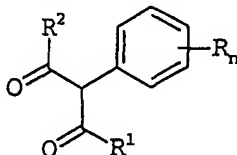
4. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Ansprüchen 1 bis 3 durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der Formel II



II

20

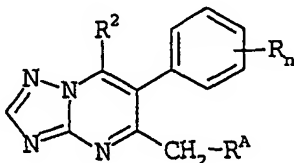
mit Dicarbonylverbindungen der Formel III.



III

25

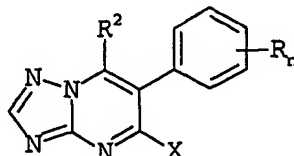
5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I'



I'

30

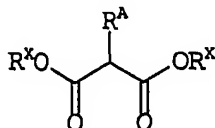
35 wobei n, R und R¹ die in Ansprüchen 1 bis 3 gegebene Bedeutung haben und R^A Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl, das gemäß Ansprüchen 1 bis 3 substituiert sein kann, bedeutet, durch Umsetzung von Halogenverbindungen der Formel IV



IV

40

in der X für Halogen steht, mit substituierten Malonsäureestern der Formel V,



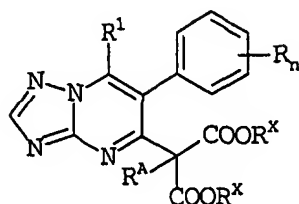
V

45

51

in der R^x für C_1 - C_4 -Alkyl, Allyl, Phenyl oder Benzyl steht, zu Verbindungen der Formel VI

5

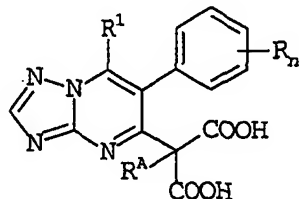


VI

10

anschließender Verseifung von VI zu der Säure VIa und Decarboxylierung von VIa

15



VIa

6. Dicarbonylverbindungen der Formel III gemäß Anspruch 4, in denen n eine ganze Zahl von 1 bis 5 ist und R^1 und R^2 nicht beide Methyl bedeuten.
7. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.
8. Verwendung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1 zur Herstellung eines zur Bekämpfung von Schadpilzen geeigneten Mittels.
9. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

35

40

45

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
16. Januar 2003 (16.01.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 03/004465 A3

(51) Internationale Patentklassifikation: C07D 487/04,
A01N 43/653

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/07340

(22) Internationales Anmeldedatum:
3. Juli 2002 (03.07.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
101 32 059.0 5. Juli 2001 (05.07.2001) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE];
67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): MÜLLER, Bernd
[DE/DE]; Jean-Ganss-Strasse 21, 67227 Frankenthal

(DE). SAUTER, Hubert [DE/DE]; Neckarpromenade 20,
68167 Mannheim (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE];
Goethestrasse 21, 56288 Kastellaun (DE). GRAM-
MENOS, Wassilios [GR/DE]; Samuel-Hahnemann-Weg
9, 67071 Ludwigshafen (DE). TORMO I BLASCO,
Jordi [ES/DE]; Mühlweg 47, 67117 Limburgerhof
(DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Hoehnhausen 18,
67157 Wachenheim (DE). GYPSEER, Andreas [DE/DE];
B 4,4, 68159 Mannheim (DE). RHEINHEIMER,
Joachim [DE/DE]; Merziger Strasse 24, 67063 Lud-
wigshafen (DE). ROSE, Ingo [DE/DE]; C 2, 19, 68159
Mannheim (DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römer-
strasse 1, 67308 Ottersheim (DE). SCHIEWECK, Frank
[DE/DE]; Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). RACK,
Michael [DE/DE]; Sandwingert 67, 69123 Heidelberg
(DE). LORENZ, Gisela [DE/DE]; Erlenweg 13, 67434
Hambach (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE];
Donnersbergstrasse 9, 67117 Limburgerhof (DE). AM-
MERMANN, Eberhard [DE/DE]; Von-Gagern-Strasse 2,
64646 Heppenheim (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE];
Ginsterstrasse 17, 67112 Mutterstadt (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGE-
SELLSCHAFT; 67056 Ludwigshafen (DE).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: FUNGICIDAL TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF AND USE THEREOF
IN CONTROLLING NOXIOUS FUNGI AND AGENTS CONTAINING SAID COMPOUNDS

(54) Bezeichnung: FUNGIZIDE TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWEN-
DUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL

(57) Abstract: Triazolopyrimidines of formula (I), wherein the index and substituents have the following meaning: n = 0 or a whole number of 1 - 5; R = halogen, cyano, hydroxy, cyanate, alkyl, alkenyl, alkynyl, halogenalkyl, halogenalkenyl, alkoxy, alkenyloxy, alkinyloxy, halogenalkoxy, cycloalkyl, cycloalkenyl, cycloalkoxy, alkoxycarbonyl, alkenyloxycarbonyl, alkinyloxycarbonyl, aminocarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkoximinoalkyl, alkenyloximinocarbonyl, alkinyloximinocarbonyl, alkylcarbonyl, alkenylcarbonyl, alkynylcarbonyl, cycloalkylcarbonyl or a five to ten membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, containing one to four heteroatoms from the group O, N or S; R¹ = alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, phenyl, naphthyl or a five to ten membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, containing one to four heteroatoms from the group O, N or S, R and/or R¹ being able to be substituted according to the description; R² = alkyl, alkenyl or alkynyl which can be substituted by halogen, cyano, nitro, alkoxy or alkoxycarbonyl. The invention also relates to a method for the production of said compounds, agents containing same, and the use thereof in controlling noxious fungi.

(57) Zusammenfassung: Triazolopyrimidine der Formel (I), in der der Index und die Substituenten folgende Bedeutung haben: n 0 oder eine ganze Zahl von 1 bis 5; R Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanat, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkoxy, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Cycloalkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyloxycarbonyl, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkoximinoalkyl, Alkenyloximinocarbonyl, Alkinyloximinocarbonyl, Alkylcarbonyl, Alkenylcarbonyl, Alkynylcarbonyl, Cycloalkylcarbonyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclen, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S; R¹ Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclen, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei R und/oder R¹ gemäss der Beschreibung substituiert sein können; R² Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl, die durch Halogen, Cyano, Nitro, Alkoxy oder Alkoxycarbonyl substituiert sein können; Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen.



WO 03/004465 A3



(81) **Bestimmungsstaaten (national):** AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) **Bestimmungsstaaten (regional):** ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT,

SE, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

(88) **Veröffentlichungsdatum des internationalen
Recherchenberichts:**

8. Mai 2003

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D487/04 A01N43/653

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, PAJ, WPI Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO) 8 April 1998 (1998-04-08) cited in the application page 5, line 49-52 page 5, line 26 -page 5, line 56; claims 1-6,11-13	1-5,7-9
X	EP 1 048 649 A (NISSIN FOOD PRODUCTS LTD) 2 November 2000 (2000-11-02) page 25, line 15 -page 25, line 16 --- -/--	6

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

*** Special categories of cited documents :**

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *&* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

20 January 2003

Date of mailing of the international search report

0 6. 02. 03

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Schmid, A

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	C.W. CHOPPEE; J. CYMERMAN CRAIG; R. E. LACK: "Acetylenic Compounds related to Stilben. Part III. Acetylenic Alcohols derived from alpha-Alkyldeoxyanisoin, and the alpha-Alkyl-beta-ethynylstilbenes" J. CHEM. SCO., 1961, pages 1311-1321, XP009004205 page 1316, compound XXI -----	6
A	WO 99 41255 A (AMERICAN CYANAMID CO) 19 August 1999 (1999-08-19) cited in the application page, biological investigations to page 28, table III claims 1-6; examples -----	1-5,7-9

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

See supplemental sheet

1. ☒ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☒ No protest accompanied the payment of additional search fees.

The International Searching Authority has determined that this international application contains multiple (groups of) inventions, namely

1. Claims 1-5 and 7-9

compounds of Formula I, their preparation and their use in a fungicide.

2. Claim 6

compounds of Formula III according to the definition given in Claim 6.

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)		Publication date
EP 0834513	A	08-04-1998	US	5817663 A	06-10-1998
			AT	221069 T	15-08-2002
			DE	69714171 D1	29-08-2002
			DE	69714171 T2	12-12-2002
			EP	0834513 A2	08-04-1998
			JP	10152489 A	09-06-1998
			US	5965561 A	12-10-1999

EP 1048649	A	02-11-2000	AU	1691399 A	19-07-1999
			CA	2316953 A1	08-07-1999
			EP	1048649 A1	02-11-2000
			US	6294568 B1	25-09-2001
			WO	9933796 A1	08-07-1999

WO 9941255	A	19-08-1999	US	6020338 A	01-02-2000
			AU	750489 B2	18-07-2002
			AU	2595299 A	30-08-1999
			BR	9907863 A	24-10-2000
			CA	2320304 A1	19-08-1999
			CN	1292790 T	25-04-2001
			CZ	20002933 A3	17-04-2002
			EP	1054888 A1	29-11-2000
			HU	0100885 A2	28-06-2001
			JP	2002503664 T	05-02-2002
			PL	342576 A1	18-06-2001
			WO	9941255 A1	19-08-1999

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D487/04 A01N43/653

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, PAJ, WPI Data, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO) 8. April 1998 (1998-04-08) in der Anmeldung erwähnt page 5, line 49-52 Seite 5, Zeile 26 -Seite 5, Zeile 56; Ansprüche 1-6,11-13 ---	1-5,7-9
X	EP 1 048 649 A (NISSIN FOOD PRODUCTS LTD) 2. November 2000 (2000-11-02) Seite 25, Zeile 15 -Seite 25, Zeile 16 --- -/--	6



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

- * "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- * "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- * "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- * "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- * "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

* "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

* "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

* "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

* "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

20. Januar 2003

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

06.02.03

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Schmid, A

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	C.W. CHOPPEE; J. CYMERMAN CRAIG; R. E. LACK: "Acetylenic Compounds related to Stilben. Part III. Acetylenic Alcohols derived from alpha-Alkyldeoxyanisols, and the alpha-Alkyl-beta-ethynylstilbenes" J. CHEM. SOC., 1961, Seiten 1311-1321, XP009004205 page 1316, compound XXI ---	6
A	WO 99 41255 A (AMERICAN CYANAMID CO) 19. August 1999 (1999-08-19) in der Anmeldung erwähnt page, biological investigations to page 28, table III Ansprüche 1-6; Beispiele -----	1-5,7-9

Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☐ Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
2. ☐ Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. ☐ Ansprüche Nr.
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

· siehe Zusatzblatt

1. ☒ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. ☐ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

☐ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.

☒ Die Zahlung zusätzlicher Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-5,7-9

Verbindungen der Formel I, ihre Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen

2. Anspruch : 6

Verbindungen der Formel III entsprechend der Definition gemäß Anspruch 6

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
EP 0834513	A	08-04-1998	US	5817663 A	06-10-1998
			AT	221069 T	15-08-2002
			DE	69714171 D1	29-08-2002
			DE	69714171 T2	12-12-2002
			EP	0834513 A2	08-04-1998
			JP	10152489 A	09-06-1998
			US	5965561 A	12-10-1999
EP 1048649	A	02-11-2000	AU	1691399 A	19-07-1999
			CA	2316953 A1	08-07-1999
			EP	1048649 A1	02-11-2000
			US	6294568 B1	25-09-2001
			WO	9933796 A1	08-07-1999
WO 9941255	A	19-08-1999	US	6020338 A	01-02-2000
			AU	750489 B2	18-07-2002
			AU	2595299 A	30-08-1999
			BR	9907863 A	24-10-2000
			CA	2320304 A1	19-08-1999
			CN	1292790 T	25-04-2001
			CZ	20002933 A3	17-04-2002
			EP	1054888 A1	29-11-2000
			HU	0100885 A2	28-06-2001
			JP	2002503664 T	05-02-2002
			PL	342576 A1	18-06-2001
			WO	9941255 A1	19-08-1999